

(C) WPI / DERWENT

XP-002392535

AN - 1978-05666A [25]

CPY - MATS-I

DC - B04

FS - CPI

IC - A61K35/78

MC - B04-A07F B12-G07

M1 - [01] V400 V406 P631 P633 P634 M781 R000 M423 M902

PA - (MATS-I) MATSUI T

PN - JP52145509 A 19771203 DW197803 000pp

PR - JP19760061362 19760527

XIC - A61K-035/78

AB - J52145509 Anti-cancer agent contains as effective ingredient a bitter principle of hops of *Humulus lupulus* L. (Moraceae). The anti-cancer effect is conc. in the cone of hops, partic. in the bitter principle of lupulin particles (contg. yeast for beer brewing) which contain mainly vegetable female hormone.

- Hop cones collected after 35-45 days from flowering are dried in the sand or under hot air at 40-60 degrees C for 5-15 hrs. until the moisture content is 10-20%. The resulting dry hop contains 6-17% moisture, 0.13-0.48% essential oil, 7-25% resin (water soluble resin contg. humulone and lupulin), 7-11% tannin, 10-17% nitrogenic cpd., 10-18% fibrous material, 5-10% ash and yeast. The dry hop is placed in a cloth bag and immersed in pure water in a ceramic pot or pressure pot at a rate of 5-10 g./l. at 60-65 degrees C for 1-3 hrs. and then at 90-100 degrees C for 30-60 secs., during which time the lost amt. of water is supplied little-by-little. The bag taken out of the water is allowed to cool. The resulting hop extract exhibits a bitter taste, shows strong permeability and antiseptic sterilisability to the mucous membrane and skin, promotes metabolism, and improves the circulation of the blood. The extract is effective in treatment of diabetes, hypertension and gastro enteric disorders without any adverse reaction. It is partic. effective against cancers of the stomach, bladder, liver, lung and breast.

IW - ANTICANCER AGENT BITTER PRINCIPLE HOP HUMULUS LUPULUS

IKW - ANTICANCER AGENT BITTER PRINCIPLE HOP HUMULUS LUPULUS

NC - 001

OPD - 1976-05-27

ORD - 1977-12-03

PAW - (MATS-I) MATSUI T

TI - Anticancer agent - including the bitter principle of hops of *Humulus lupulus*

THIS PAGE BLANK (USP12)

⑩日本国特許庁
公開特許公報

⑪特許出願公開
昭52—145509

⑫Int. Cl.
A 61 K 35/78

識別記号
ADU

⑬日本分類
30 A 31
30 H 52

庁内整理番号
6617—44
5727—44

⑭公開 昭和52年(1977)12月3日

発明の数 1
審査請求 有

(全 5 頁)

⑮がん治療薬

⑯特 願 昭51—61362

⑰出 願 昭51(1976)5月27日

⑱発 明 者 松井徳太郎

岐阜県吉城郡古川町幸栄町1番

43号

⑲出 願 人 松井徳太郎

岐阜県吉城郡古川町幸栄町1番
43号

⑳代 理 人 弁理士 恩田博宣

明 細 書

1. 発明の名称

が ん 治 療 薬

2. 特許請求の範囲

1 桑科植物のホツブの苦味成分を有効成分とするがん治療薬。

3. 発明の詳細な説明

本発明はホツブの苦味成分を有効成分とするがん治療薬に関するものである。

近年、癌病でしかも死亡率の高い胃がん、肺がん等のがん(癌)は世界中の学者が巨費を投じてその原因及び治療方法を研究中であるにもかかわらず、その発生原因はウイルスともいわれ、又、がん細胞ともいわれ、あるいは発がん物質ともいわれ、それら諸説のうちどれが正しいのかさだめられておらず、従つて、この原因不明のがんに対して著しい効果のある化学療法(薬剤)が発見されていない現状である。

今のところ、このがんを全治する最も有効な方法としては早期発見して外科的療法(手術)を用いる以外になく、一度ある一定の症状までがんが進む(転移)ともうどんな療法を用いても全治させることは不可能であつて、このために多くの確い人命が失なわれてきた。

そして重症のがん患者に対しては化学療法以外に対処することができず、このため多くの薬剤が開発されたが、これらはいずれもがんを根治させるものではなく、さらにはがんに特効のある薬剤はすべて人体に重大な副作用を誘発するためまだ無毒無害のがん治療薬は発見されていないのが実情であり、従つて無毒無害でしかも特効のあるがん治療薬の開発が医学上の大きな課題であつた。

ところで、出願人は酒類販売を永年営んでいるため、酒類のうちで、日本酒とビールとをそれぞれ飲用している多数の人々の健康状態を直接観察することができ、その結果日本酒ばかりを飲用し

ている人にはがんをはじめ高血圧、脳出血等の病気になる人があり、ビールばかりを飲用している人には、このビールのために死亡したり病気になる者があり、このビールのために死亡したり病気になる者が一人もないという統計的事実を知ることができた。

本発明は上記の事からビールの中に含まれるホップががん等の病気を未然に防ぎかつ制圧するこのホップの球果を実験的に研究した結果、のではないかと考え、そのホップの球果特に植物性女性生殖ホルモンを主成分とするルプリン粒（ビール醸造用酵母を含有する）の苦味成分に像れたがん治療効果があることが判り、この点に注目してなされたものである。

本発明はこの発見に基づいてなされたものであって、像れたがん治療効果を発揮するがん治療薬を提供することを目的とする。

本発明はこの目的を合理的に達成した技術的思想の創作である。

まず最初に、ホップの概要について説明する。

とされている。さらに、ビール醸造の有効成分は大部分がこのルプリン粒中に含まれており、このルプリン粒は女性生殖ホルモンを主成分とし特有の香気とはなはだしい苦味をもつものである。

以下本発明を具体化した一の実施態様を説明すると、本発明ではまず、ホップの球果を開花後35～45日で収穫する。この収穫時期は球果の内筒と外筒との基部に分泌されるルプリン粒が球果全体にわたって完成した時期であり、収穫時期が早い場合にはルプリン粒の分泌が不完全で有効成分を十分に得ることができず、又、収穫時期が遅れた場合にはルプリン粒が変質するとともに、その色も赤味をおびて変色し有効成分が分解するものであつて、特に開花後40日頃収穫するのが最適である。

次に前記の収穫したホップの球果を陰干して目又は40～60℃熱風で5～15時間強制乾燥、乾燥して、水分含量10～20%とする。前記の自然乾燥による場合は必ず陰干しにすべきであ

特開 昭52-145509 図

ビールの醸造に使用するホップは熱帯に属する性的雌雄異株の多年性草本であつて、その栽培には年間平均気温が8.3～9.5℃で、生育期間（4月～8月）の平均気温が14.5～17℃で、夏の月平均気温20℃を越えることのない比較的冷涼な温帯地方が適し、日本ではビールの醸造用として北海道、青森、秋田、山形、岩手、宮城、福島、群馬、山梨、新潟、長野等で栽培されている。

又、ホップは6月下旬から7月上旬にかけて開花しはじめ、特にビールの醸造に使用する雌花は中軸に多数の苞が重なり合つて覆いた松かさ状の緑色球果で、開花後10日目頃から球果の内筒と外筒との基部にあるルプリン腺毛から樹脂性物質の分泌物がはじまり、その分泌物ははじめ無色であるがやがて淡黄色から透明な黄白色となり、これをルプリン粒といつて球果の大部分のルプリン粒が完成するのに開花後35～45日間かかるもの

り、これはホップの球果を日光にさらすと特に前記ルプリン粒が変質して有効成分が分解する危険があるためである。又、熱風乾燥による場合には、熱風の温度をあまり高くすると球果が褐色にこけてルプリン粒に含まれる有効成分も少なくなるため、前記の温度範囲で行なう必要があり、55℃程度の熱風が最適である。

さらに、同熱風乾燥における所定時間は熱風温度を前記範囲内で高く設定すれば短くなるものである。熱風温度を55℃程度に設定した場合には、球果の苞が4～5時間程度で水分含量20%程度となり、6時間程度で10%程度となるが、中軸では50%程度の水分を含んでいるため、さらに4時間程度の乾燥時間が必要であり、従つて、熱風乾燥の場合には55℃程度の熱風で10時間程度乾燥するのが最適である。

前記のようにして製造された乾燥ホップの成分は水分6～17%、精油0.13～0.48%、樹脂

7~25%, タンニン7~11%, 全窒素物質10~17%, 粗繊維10~18%, 灰分5~10%, 酵母を含有し、前記樹脂の中にはフミロン、ルプリンを含みこの樹脂は水解性を有している。

次に前記のように自然乾燥又は熱風乾燥により水分含量10~20%に乾燥したホップの球果を布袋等で包つた袋に入れ、これを陶器製の土瓶又は高圧の鍋、釜等を用いて5~10g/lの割合で清水内に浸し、蒸気する水分を徐々に補給しながら80~65℃で1~3時間煮出した後に90~100℃で30~60秒間煮立て、前記袋を取り出して自然冷却する。

この場合に使用する容器は前記のような陶器製の非金属性のものを用いる必要があり、これは例えば鉄製の容器を使用した場合にはホップの球果に含まれるタンニンが鉄と結合して不溶性のタンニン鉄となり、できあがつたホップエキス中にそのタンニン鉄ががん治療薬としての効果の全く

記の80~65℃で1~3時間煮出す場合には、始めにホップの球果に対し前記の割合で水を入れ煮つまつてきたら水をそそいで最終的に前記の割合となるようにするのが望ましい。

このように製造した煎薬状のホップエキスは甚だしい苦味を呈し、粘膜及び皮膚に対し著しい浸透吸収性と防腐殺菌力を有し、新陳代謝を促進して血行をよくする作用を有し、しかも人体には無毒無害であるという特性を有している。

なお、前記防腐殺菌力については次のような実験結果がある。

すなわち、900mlの生牛乳に前記ホップエキス5mlを混和して1ヶ月後に検査したところ、腐敗変質せず、カビの発生を見なかつたが、ホップエキスを添加しなかつた生牛乳はカビのコロニーが発生し緑カビが大繁殖した。

なお、前記ホップエキスは糖尿病、高血圧、胃腸病等の諸病に防き目があることが実験的に立証

特開昭52-145509(3)

ない不純物として混入するためである。又、ホップの球果と清水との割合は前記のように5~10g/lの範囲とするべきであり、ホップの球果の量がこれよりも少ないとできあがつたホップエキスが希釈で有効成分の少ないものとなり、又、ホップの球果の量をこれ以上多くしても清水中に溶出される有効成分の量が変らず、同球果中に残るものである。

さらに、前記の割合の加熱温度は、ホップの球果に含まれる有効成分の一種が60~65℃で極めて溶出しやすく、又、有効成分のその他の一種が90~100℃で溶出しやすい性質を有することが実験研究により判明したのでこの範囲内で煮出し及び煮立てするのが最適であり、その所要時間については前記範囲よりも少ない場合には有効成分が充分に溶出されず希釈なものとなり、逆に煮出し時間を多くしてもそれ以上の有効成分が溶出しないので、2時間程度が最適である。又、前

されている。

最後に前記ホップエキスを無害な薬用基剤に配合してがん治療薬を製造することができる。

このように無毒無害のホップにより製造したがん治療薬は全く副作用を心配することなくこれを一般の煎薬と同様に服用することができ、胃がん、膀胱がん、肝臓がん等各種のがんの治療に優れた効果を発揮することが実験研究の結果判明した。次にその二例を順次説明する。

(実験結果1)

岐阜県吉城郡古川町在住の患者Aさんは昭和47年9月から血尿がでるようになり、高山市のある病院で膀胱がんと診断された。翌年6月名古屋のがん研究所に入院し、イギリス式水圧療法を5回試みたが全治せず、同研究所において手術するよう勧められた。しかし、手術して死亡する患者を多く見てきたAさんは手術ではどうにもならないと考えて退院し、食事療法をするようになった。

ところが当時 A さんはホツアよりなるがん治療薬が難病である糖尿病によくきくことを知っていたので、このがん治療薬を服用し始め約半年ほどで大分快方に向い、その後二年間継続して服用したところ、益々快方に向い今日では元の体になりこのがん治療薬によりかなり重症であつた膀胱がんが全治した。

(実験結果 2)

岐阜県吉城郡古川町主婦 B さんは昭和 49 年 1 月高山市のある病院にて胃がんの手術を受けたのち同年 5 月に退院し、自宅療養をしていた。それから B さんは 1 年半ほど通院して次第に快方へ向うようになつたが、50 年 7 月ごろになつて胃がんが転移し舌がんになつたと診断された。そこで B さんは 5 種類の外のがん治療薬を服用していたのですが、胃が悪くなつてついには服薬を中止しました。出知人がこの B さんに前記のがん治療薬を服用させたところ、めきめきと快くなり 1 ケ月し

し、この粉末状のホツアをそのままがん治療薬とすること。又、この粉末状のホツアを他の薬用基剤に配合してがん治療薬とすること。

この場合の作用効果は前記第一実施態様と同様である。

(イ) 又、前記ホツアエキス又は粉末状のホツアをそのままがん治療薬とする場合、あるいは他の薬用基剤に配合してがん治療薬とする場合に癌制がん剤等を添加すること。

(ロ) なお、本発明のもう一つの実施態様について説明する。

前記乾燥ホツアを 300 メッシュの微粉に粉碎して陶磁器製の土瓶 (1.8 ℓ) に 1.5 ℓ の水を入れ、この中へ前記粉末ホツア 5 g を投入してよく攪拌し弱火のプロパンガスで 2 時間蒸出する。この間に全水の約 1/3 が減量するからこの量だけ蒸し水を行なつて最後に強火のプロパンガスで 30 秒間煮沸して火力を止め、1.5 ℓ の

特開 昭 52-145509 (4)
て 9 月にはおかゆ食が食べられるようになり、2 ケ月して普通食となり 3 ケ月して稲刈りの田舎へ軽々仕事に出られるようになり、それからさらに元気がで健康なときと察らない体に回復し全治した。

なお、本発明は前記第一実施態様に限定されるものではなく、次のような態様で具体化することも可能である。

(イ) 前記第一実施態様ではホツアエキスを他の薬用基剤に配合して、煎薬状のがん治療薬としたが、前記ホツアエキスをそのままがん治療薬とすること。この場合にも前記第一実施態様と同様の作用効果がある。

(ロ) 前記第一実施態様ではホツアエキスを他の薬用基剤に配合して、がん治療薬としたが、これを前記のように自然乾燥又は熱風乾燥により水分含量 10~20% に乾燥したホツアの球果を粉碎機等により粉碎して粉末状のホツアを製造

する。

ホツアエキスを製造し、このホツアエキスをそのままあるいは他の薬用基剤に配合してがん治療薬を得た。

得られたがん治療薬は優れたがん制癌作用を有する。

(ロ) 前記実施態様では煎薬状、粉末状のがん治療薬を製造するようにしたが、これを飲みやすいように粒状にしたり、カプセル入りにしたりすること。

なお、前記実施態様ではがん治療薬を服用するようにしたが、これ以外に例えば、血液中に注射したり、皮膚に塗布したり、あるいは手術した疾患部の後に注入したりして使用することも可能である。又、がん患者以外の者に服用させ、がん予防薬として使用することも可能である。

以上詳述したように、本発明は桑科植物のホツアの苦味成分を有効成分としたことにより、胃が

ん、肺がん、乳がん、肝臓がん等の各種のがん患者に対し、全く副作用を心配することなく投与して各種がんを治療することができる効果を奏するので、がん治療薬として優れた発明である。

特許出願人 松井 徳太郎
代理人 井理士 恩 田 博 宣

特開 昭52-145509(5)

自 発 手 続 補 正 書

昭和 51 年 6 月 24 日

特許庁長官 片 山 石 郎 殿

1. 事件の表示

特願 昭 51-61862

2. 発明の名称

がん治療薬

3. 補正をする者

事件との関係

特許出願人

住 所

松 井 徳 太 郎

氏 名

4. 代 理 人

住 所 ● 500 岐阜市瑞穂町2番地

TEL 0582 65-1810

氏 名 6875 井理士 恩 田 博 宣

5. の日付

6. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄

7. 補正の内容

明細書中第9頁第12行目の「・・・900mgの生牛乳に・・・」の記載を「・・・200mgの生牛乳に・・・」と補正します。

THIS PAGE BLANK (USPTO)